

2001-0441A
Miura



0400.
05-24-07. ~~0280~~

IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

In re application of : ATTN: APPLICATION BRANCH
Hiroyuki MIURA et al. : Docket No. 2001_0441A
Serial No. 09/840,820 :
Filed April 25, 2001 :
METHOD FOR CONTROLLING FLIES

CLAIM OF PRIORITY UNDER 35 USC 119

Assistant Commissioner for Patents,
Washington, DC 20231

Sir:

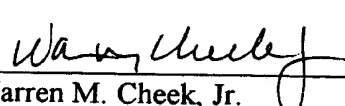
Applicants in the above-entitled application hereby claim the date of priority under the International Convention of Japanese Patent Application No. 131562/2000, filed April 26, 2000, as acknowledged in the Declaration of this application.

A certified copy of said Japanese Patent Application is submitted herewith.

Respectfully submitted,

Hiroyuki MIURA et al.

By


Warren M. Cheek, Jr.
Registration No. 33,367
Attorney for Applicants

THE COMMISSIONER IS AUTHORIZED
TO CHARGE ANY DEFICIENCY IN THE
FEE FOR THIS PAPER TO DEPOSIT
ACCOUNT NO. 25-0975.

WMC/dlk
Washington, D.C. 20006-1021
Telephone (202) 721-8200
Facsimile (202) 721-8250
May 22, 2001

【書類名】 特許願

【整理番号】 B00099

【提出日】 平成12年 4月26日

【あて先】 特許庁長官 殿

【国際特許分類】 A01N 25/00

【発明の名称】 ハエ類の防除方法

【請求項の数】 8

【発明者】

【住所又は居所】 東京都豊島区高田2丁目18番31-425号

【氏名】 三浦 洋之

【発明者】

【住所又は居所】 茨城県つくば市東2丁目3番地6 リッシェル筑波20
2号

【氏名】 赤山 敦夫

【特許出願人】

【識別番号】 000002934

【氏名又は名称】 武田薬品工業株式会社

【代理人】

【識別番号】 100114041

【弁理士】

【氏名又は名称】 高橋 秀一

【選任した代理人】

【識別番号】 100110456

【弁理士】

【氏名又は名称】 内山 務

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 005142

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【包括委任状番号】 9909276

【包括委任状番号】 9721047

【ブルーフの要否】 要

【書類名】明細書

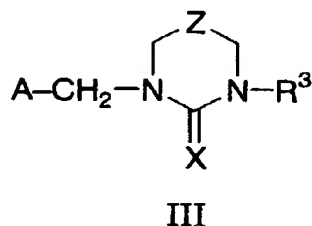
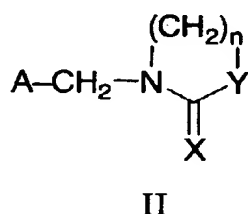
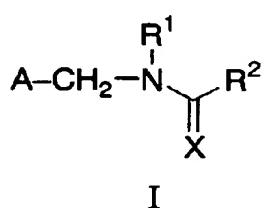
【発明の名称】ハエ類の防除方法

【特許請求の範囲】

【請求項1】昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を用いることを特徴とする畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類の防除方法。

【請求項2】化合物またはその塩が下記一般式〔I〕、〔II〕もしくは〔III〕

【化1】



〔式中、Aは6-クロロ-3-ピリジル基、2-クロロ-5-チアゾリル基、テトラヒドロフラン-3-イル基、5-メチルテトラヒドロフラン-3-イル基、3-ピリジル基、6-ブromo-3-ピリジル基、3-シアノフェニル基、2-メチル-5-チアゾリル基、2-フェニル-5-チアゾリル基または2-ブromo-5-チアゾリル基を、 R^1 は水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、プロペニル基、プロピニル基、ホルミル基、アセチル基またはメトキシカルボニル基を、 R^2 はメチル基、エチル基、アミノ基、メチルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N-メチル-N-エチルアミノ基、1-ピロリジニル基、N-メチルホルムアミド基、N-メチルアセトアミド基またはN-メチル-N-(メトキシカルボニル)アミノ基を、 R^3 は水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、プロペニル基、プロピニル基、ホルミル基、アセチル基またはメトキシカルボニル基を、Xはニトロメチレン基、ニトロイミノ基、シアノイミノ基またはトリフルオロアセチルイミノ基を、YはN(R^4)で表わされる基(R^4 は R^1 と同意義を示す)または硫黄原子を、ZはN(R^5)で表わされる基(R^5 は R^1 と同意義を示す)または酸素原子を、nは2または3を示す。〕で表される化合物またはその塩である請求項1記載の防除

方法。

【請求項 3】化合物がクロチアニジン、ニテンピラム、イミダクロプリド、チアクロプリド、アセタミプリド、チアメトキサム及びジノテフランから選ばれる 1 種以上である請求項 1 記載の防除方法。

【請求項 4】化合物がクロチアニジンである請求項 1 記載の防除方法。

【請求項 5】昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を畜舎または鶏舎内に散布することを特徴とする請求項 1 記載の防除方法。

【請求項 6】昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を畜舎または鶏舎内に塗布することを特徴とする請求項 1 記載の防除方法。

【請求項 7】昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を含有する毒餌を畜舎または鶏舎内に静置することを特徴とする請求項 1 記載の防除方法。

【請求項 8】昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を含有することを特徴とする畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類の防除用組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体（以下、「NACR」と略記することがある。）に対して結合活性を有する化合物またはその塩を用いて畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類の防除方法及び該化合物またはその塩を含有する、畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類の防除用組成物に関する。

NACRに対して結合活性を有する化合物としては、NACRのアゴニスト活性またはアンタゴニスト活性を有する殺虫性化合物（以下、これらを「NACR A系殺虫性化合物」と略記することがある。）が挙げられる。

【0002】

【従来の技術】

従来畜舎または鶏舎のハエ類に対する防除剤としては、有機リン剤、合成ピレスロイド剤、IGR剤（キチン生合成阻害剤）及びJHM剤（幼若ホルモン用物質）等が使用されているが、これらの限られた薬剤が繰り返し使用されることにより、薬剤抵抗性のハエ類が出現したりあるいは特にIGR剤やJHM剤では遅効的であるなど様々な問題を抱え、満足できる状況にない。また、合成ピレスロイド剤には忌避作用があることが知られているが、薬剤処理後一見ハエ類が減少したように見えても、実際は畜舎または鶏舎の周囲に移動しており、場合によっては周辺住民に不快感を与えることもある。

一方、NACRA系殺虫性化合物としては、例えばヨーロッパ特許出願公開公報第135956号、同第136636号、同第154178号、同第163855号、同第189972号、同第192060号、同第212600号、同第235725号、同第254859号、同第259738号、同第302389号、同第302833号、同第303570号、同第306696号、同第315826号、同第364844号、同第375907号、同第383091号、同第386565号、同第425978号、同第428941号、同第455000号、同第464830号、同第471372号、同第580553号；ドイツ特許出願公開公報第3639877号、同第3712307号；特開昭63-287764号、同63-307857号、特開平2-171号、同2-207083号、同3-128361号、同3-157308号、同3-169861号、同3-218370号、同3-220176号、同3-246283号、同3-255072号、同3-279359号、同4-9371号、同4-154741号、同5-271207号、同6-183918号、同7-179448号、同7-278094号；米国特許第4918086号、同第4948798号、同第5034404号、同第5034524号、同第5039686号；PCT国際公開公報WO91/4965号、同91/17659号；フランス特許出願第2611114号；ブラジル特許出願第8803621号等に記載された化合物が挙げられる。これらのNACRA系殺虫性化合物はネオニコチノイド系

化合物、ニトロメチレン系化合物、クロロニコチニル系化合物またはチアニコチニル系化合物と称されることもある。これらの中からいくつかの化合物が高活性な農業用殺虫剤として上市されているか、あるいは開発中である。

これら特許（出願）の公報中には、農業用害虫のみならず、衛生害虫にも効果がある旨記載したもの（例えば特開平 3 - 1 5 7 3 0 8 号）もあるが、畜舎または鶏舎のハエ類に対する防除について言及したものは皆無である。

さらに、主にイヌ・ネコのノミの駆除のため、これらの N A C R A 系化合物を直接宿主動物に処理する方法が例えば特開平 8 - 9 2 0 9 1 号及び特開 2 0 0 0 - 6 3 2 7 1 号に記載されているが、畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類の防除については全く記載されていない。

【 0 0 0 3 】

【発明が解決しようとする課題】

畜舎または鶏舎のハエ類としては、皮膚に幼虫が寄生するウシバエや刺咬性のあるサシバエのように直接家畜類に苦痛を与えるものや間接的に悪影響を及ぼすイエバエ、オオイエバエ、ヒメイエバエなどがある。このような間接的な悪影響としては、幼虫が糞を軟化させることによるアンモニアの発生による悪臭や成虫による家畜・家禽類や人間への各種疾病の伝播などがある。ハエ成虫が伝播する疾病の具体例としては、例えば鶏のニューカッスル病及び鳥インフルエンザ等、豚の伝染性胃腸炎及び豚コレラ等、牛の乳房炎及び口蹄疫等、人間の赤痢、コレラ、食中毒（例、サルモネラ菌、病原性大腸菌 O 1 5 7 等による食中毒など）等が挙げられる。さらに、ハエ類は不潔害虫とみなされることから、周辺住居に飛来することによる住民とのトラブル等も問題となっている。従って、これらハエ類の防除は畜産農家にとって極めて重要である。

しかしながら、上記したように抵抗性の発達等の問題を抱える現状において、高活性で新しいタイプのハエ類防除剤の開発が望まれている。

【 0 0 0 4 】

【課題を解決するための手段】

本発明者は上記現状に鑑み、新しいタイプの畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類の防除剤を鋭意探索した結果、まさに驚くべきことに、N A C R A 系

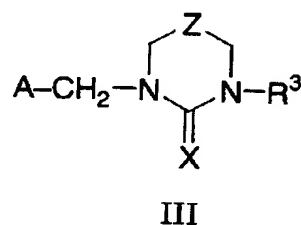
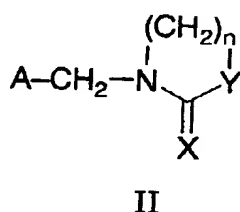
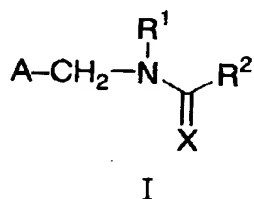
殺虫性化合物がこれらハエ類に対し極めて高活性であることを見出し、さらに検討を加えた結果、本発明を完成した。

すなわち本発明は、

[1] 昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を用いることを特徴とする畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類の防除方法、

[2] 化合物またはその塩が下記一般式〔I〕、〔II〕もしくは〔III〕

【化 2】



[式中、Aは6-クロロ-3-ピリジル基、2-クロロ-5-チアゾリル基、テトラヒドロフラン-3-イル基、5-メチルテトラヒドロフラン-3-イル基、3-ピリジル基、6-ブromo-3-ピリジル基、3-シアノフェニル基、2-メチル-5-チアゾリル基、2-フェニル-5-チアゾリル基または2-ブromo-5-チアゾリル基を、R¹は水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、プロペニル基、プロピニル基、ホルミル基、アセチル基またはメトキシカルボニル基を、R²はメチル基、エチル基、アミノ基、メチルアミノ基、N,N-ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、N,N-ジエチルアミノ基、N-メチル-N-エチルアミノ基、1-ピロリジニル基、N-メチルホルムアミド基、N-メチルアセトアミド基またはN-メチル-N-(メトキシカルボニル)アミノ基を、R³は水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、プロペニル基、プロピニル基、ホルミル基、アセチル基またはメトキシカルボニル基を、Xはニトロメチレン基、ニトロイミノ基、シアノイミノ基またはトリフルオロアセチルイミノ基を、YはN(R⁴)で表わされる基(R⁴はR¹と同意義を示す)または硫黄原子を、ZはN(R⁵)で表わされる基(R⁵はR¹と同意義を示す)または酸素原子を、nは2または3を示す。]で表される化合物またはその塩である上記[1]項記載の防

除方法、

[3] 化合物がクロチアニジン、ニテンピラム、イミダクロプリド、チアクロプリド、アセタミプリド、チアメトキサム及びジノテフランから選ばれる1種以上である上記[1]項記載の防除方法、

[4] 化合物がクロチアニジンである上記[1]項記載の防除方法、

[5] 昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を畜舎または鶏舎内に散布することを特徴とする上記[1]項記載の防除方法、

[6] 昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を畜舎または鶏舎内に塗布することを特徴とする上記[1]項記載の防除方法、

[7] 昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を含有する毒餌を畜舎または鶏舎内に静置することを特徴とする上記[1]項記載の防除方法、および

[8] 昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を含有することを特徴とする畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類の防除用組成物に関する。

【0005】

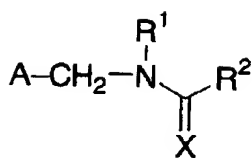
【発明の実施の形態】

NACRに対して結合活性を有する化合物の具体例としては、例えば上記特許（出願）公報中に記載の化合物が用いられ、上記特許（出願）公報に記載の方法もしくはそれに準じた方法にしたがい製造できる。

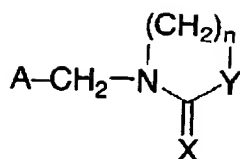
NACRA系殺虫性化合物の中でも、NACRのアゴニスト活性を有する殺虫性化合物が好ましく用いられる。

好ましくは、下記一般式〔I〕、〔II〕もしくは〔III〕

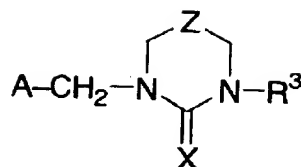
【化 3】



I



II

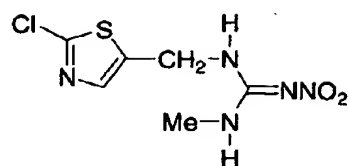


III

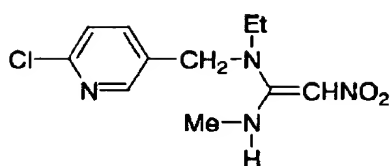
【式中の記号は前記と同意義を示す。】で表わされる化合物またはその塩が用いられる。

さらに好ましくは、クロチアニジン [(E)-1-(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イルメチル)-3-メチル-2-ニトログアニジン]、ニテンピラム [(E)-N-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-エチル-N'-メチル-2-ニトロピニリデンジアミン]、イミダクロプリド [1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-2-ニトロイミノイミダゾリジン]、チアクロプリド [3-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-2-シアノイミノ-1,3-チアゾリジン]、アセタミプリド [(E)-N¹-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N²-シアノ-N¹-メチルアセトアミジン]、チアメトキサム [3-(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イルメチル)-5-メチル-4-ニトロイミノ-1,3,5-ペルヒドロオキサジアジン及びジノテフラン [1-メチル-2-ニトロ-3-(3-テトラヒドロフリルメチル)グアニジン] が用いられる。これらの化学構造式を下記に示す。

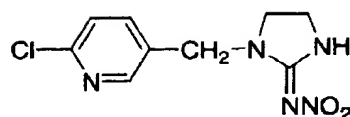
【化 4】



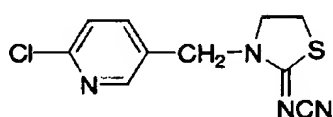
クロチアニジン



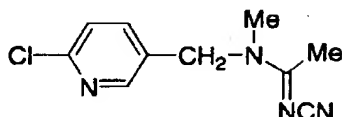
ニテンピラム



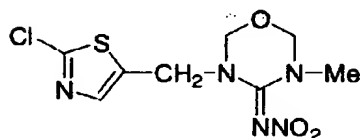
イミダクロプリド



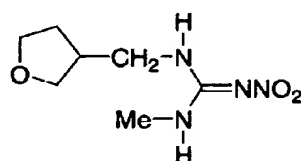
チアクロプリド



アセタミプリド



チアメトキサム



ジノテフラン

このなかで、特に好ましいのはクロチアニジンである。

【0006】

このようなNACRに対して結合活性を有する化合物は酸性物質または塩基物質と塩を形成する場合もある。これらの塩は農薬化学上許容可能な塩であればよい。すなわち、塩基物質としては例えばナトリウム、カリウム、リチウム等のアルカリ金属、カルシウム、マグネシウム等のアルカリ土類金属、アンモニアなどの無機塩基、例えばピリジン、コリジン、トリエチルアミン、トリエタノールアミンなどの有機塩基などが用いられる。酸性物質としては例えば塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、リン酸、硫酸、過塩素酸等の無機酸の塩または、例えばギ酸、酢酸、酒石酸、リンゴ酸、クエン酸、シュウ酸、コハク酸、安息香酸、ピクリン酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸の塩などが用いられる。

【0007】

これらNACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩は、家畜・人類を含む哺乳動物に対する毒性が低く、また魚毒性も低く、環境に与える影響の少

ない優れたハエ類防除剤である。

【0008】

本発明の防除対象となる畜舎または鶏舎のハエ類とは、畜舎または鶏舎に棲息し、あるいは飛来する全てのハエ類を示すが、例えばイエバエ科のイエバエ (*Musca domestica*)、ヒメイエバエ (*Fannia canicularis*)、オオイエバエ (*Musca stabulans*)、サシバエ (*Stomoxys calcitrans*) 等、クロバエ科のオオクロバエ (*Calliphora lata*)、ホホアカクロバエ (*Calliphora vicina*)、ケブカクロバエ (*Aldrichina grahami*)、ミドリキンバエ (*Lucilia illustris*) 等、ニクバエ科のセンチニグバエ (*Boettcherisca peregrina*) 等が挙げられる。畜産業において特に問題となるのは上記したイエバエ科のハエ類である。

これらハエ類は卵、幼虫、蛹、成虫の全てのステージのものが防除の対象となるが、特に幼虫及び成虫に対して高活性である。すなわち、畜舎または鶏舎に棲息するハエ類の幼虫及び成虫、または飛来するハエ類の成虫の防除方法が本発明の好ましい実施形態である。

【0009】

上記したNACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩は双翅目全般に強い殺虫活性を示すので、長角亜目に属する蚊、ブユの類及び単角亜目に属するアブの類の同時防除も可能である。

【0010】

上記したNACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩の適用場所である畜舎または鶏舎としては、牛舎、豚舎、養鶏場などが主として挙げられるが、その他の家畜・ペット類（例、ウマ、ヒツジ、ヤギ、ラクダ、水牛、ロバ、ウサギ、シカ、トナカイ、ミンク、イヌ、ネコ等）及び家禽類（例、アヒル、七面鳥、ウズラ等）などを飼育する場所も含まれる。また畜舎または鶏舎の周辺の、これらの施設から排出される糞尿、ゴミ類、落ちこぼれ飼料等の集積場所も、屋内、屋外を問わず、本発明の「畜舎または鶏舎」に含まれる。

【0011】

上記したNACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩を畜舎または鶏舎のハエ類を防除するために使用するにあたっては、一般の農薬の取り得る形

態、すなわちNACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩の一種または二種以上（好ましくは一種以上、三種以下）を有効成分として適当な液体の担体に溶解させるか分散させ、または適当な固体担体と混合させるか吸着させ、乳剤、液剤、マイクロエマルジョン、フロアブル剤、油剤、水溶剤、水和剤、顆粒水和剤、粉剤、粒剤、微粒剤、燻煙剤、錠剤、マイクロカプセル、噴霧剤、EW、軟膏、毒餌等の剤型として使用する。

これらの製剤は必要ならば例えば乳化剤、懸濁剤、展着剤、浸透剤、湿潤剤、粘漿剤、安定剤等を添加してもよく、自体公知の方法で調製することができる。

【0012】

使用する液体担体（溶剤）としては、例えば水、アルコール類（例えばメチルアルコール、エチルアルコール、n-プロピルアルコール、イソプロピルアルコール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン等）、エーテル類（例えばジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル等）、脂肪族炭化水素類（例えばケロシン、灯油、燃料油、機械油等）、芳香族炭化水素類（例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、メチルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等）、酸アミド類（例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等）、エステル類（例えば酢酸エチル、酢酸ブチル、脂肪酸グリセリンエステル等）、ニトリル類（例えばアセトニトリル、プロピオニトリル等）等の溶媒が適当であり、これらは一種または二種以上（好ましくは一種以上、三種以下）を適当な割合で混合して適宜使用することができる。

【0013】

固体担体（希釈・増量剤）としては、植物性粉末（例えば大豆粉、タバコ粉、小麦粉、木粉等）、鉱物性粉末（例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等のクレイ類、滑石粉、ロウ石粉等のタルク類、珪藻土、雲母粉等のシリカ類等）、アルミナ、硫黄粉末、活性炭等が用いられ、これらは一種または二種以上（好ましくは一種以上、三種以下）を適当な割合で混合して適宜使用することができる。

また、軟膏基剤としては、例えばポリエチレングリコール、ペクチン、例えばモノステアリン酸グリセリンエステル等の高級脂肪酸の多価アルコールエステル、例えばメチルセルロース等のセルロース誘導体、アルギン酸ナトリウム、ベントナイト、高級アルコール、例えばグリセリン等の多価アルコール、ワセリン、白色ワセリン、流動パラフィン、豚脂、各種植物油、ラノリン、脱水ラノリン、硬化油、樹脂類等の一種または二種以上（好ましくは一種以上、三種以下）、あるいはこれらに下記に示す各種界面活性剤を添加したもの等が適宜使用される。

【 0 0 1 4 】

乳化剤、展着剤、浸透剤、分散剤等として使用される界面活性剤としては、必要に応じて石鹼類、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル類〔例、ノイゲン（商品名）、イー・エー142（E・A142（商品名））；第一工業製薬（株）製、ノナール（商品名）；東邦化学（株）製〕、アルキル硫酸塩類〔例、エマール10（商品名）、エマール40（商品名）；花王（株）製〕、アルキルスルホン酸塩類〔例、ネオゲン（商品名）、ネオゲンT（商品名）；第一工業製薬（株）製、ネオベレックス；花王（株）製〕、ポリエチレングリコールエーテル類〔例、ノニポール85（商品名）、ノニポール100（商品名）、ノニポール160（商品名）；三洋化成（株）製〕、多価アルコールエステル類〔例、トゥイーン20（商品名）、トゥイーン80（商品名）；花王（株）製〕等の非イオン系およびアニオン系界面活性剤が適宜用いられる。また、NACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩と、例えば他種の殺虫剤（例、ピレスロイド系殺虫剤、有機リン系殺虫剤、カルバメート系殺虫剤、フェニルピラゾール系殺虫剤、フェニルピロール系殺虫剤、ベンゾイル尿素系殺虫剤、ジベンゾイルヒドラジン系殺虫剤、ネライストキシシン系殺虫剤、幼若ホルモン用物質、天然殺虫剤等）、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤（例えば銅系殺菌剤、有機塩素系殺菌剤、有機硫黄系殺菌剤、フェノール系殺菌剤、ベンズイミダゾール系、EBI剤、メラニン生合成阻害剤、アクリル酸エステル系など）、共力剤、誘引剤（例えば砂糖、食酢、糖蜜、粉末ミルク等）、忌避剤、色素等とを配合し、適宜使用することも可能である。

【 0 0 1 5 】

本発明のハエ類防除用組成物におけるNACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩の含有割合は、組成物全量に対して、通常約0.01～95重量%、好ましくは約0.1～80重量%程度である。具体的には、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤などで用いる場合は、通常約1～80重量%程度、好ましくは約1～20重量%程度が適当である。油剤、粉剤などで用いる場合は、通常約0.1～50重量%程度、好ましくは約0.1～20重量%程度が適当である。粒剤などで用いる場合は、通常約5～50重量%程度、好ましくは約1～20重量%程度が適当である。

本発明のハエ類防除用組成物において配合される他の活性成分（例、殺虫剤、殺ダニ剤および／または殺菌剤）は製剤全量に対して、通常約0.01～80重量%程度、好ましくは約1～20重量%程度の範囲で使用される。

上記有効成分以外の添加剤の含量は、活性成分の種類または含量、あるいは製剤の剤形などによって異なるが、通常約0.001～99.9重量%程度、好ましくは約1～99重量%程度である。より具体的には、組成物全量に対して、界面活性剤を通常約1～20重量%程度、好ましくは約1～15重量%、流動助剤を約1～20重量%程度、担体を約1～90重量%、好ましくは約1～70重量%を添加するのが好ましい。具体的には、液剤を製造する場合は、界面活性剤を通常約1～20重量%程度、好ましくは1～10重量%程度と、水を約20～90重量%添加するのが好ましい。乳剤、水和剤（例えば、顆粒水和剤）などは使用に際して、水などで適宜希釈増量（例えば、約100～5,000倍）して散布するのがよい。

【 0 0 1 6 】

本発明の防除方法において、NACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩と混合または組み合わせて使用できる殺虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤の代表例を以下に示す。

EPN (EPN)、アセフェート (acephate)、イソキサチオン (isoxathion)、イソフェンホス (isofenphos)、イソプロカルブ (isoprocarb)、エトリムホス (etrimfos)、オキシデプロホス (oxydeprofos)、キナルホス (quinalphos)

、キヤドサホス (cadusafos)、クロルエトキシホス (chlorethoxyfos)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホス—メチル (chlorpyrifos-methyl)、クロロフェンビンホス (chlorofenvinphos)、サリチオン (salithion)、シアノホス (cyanophos)、ジスルホトン (disulfoton)、ジメトエート (dimethoate)、スルプロホス (sulprofos)、ダイアジノン (diazinon)、チオメトン (thiometon)、テトラクロルビンホス (tetrachlorvinphos)、テブピリムホス (tebupirimfos)、トリクロルホン (trichlorphon)、ネイルド (naled)、バミドチオン (vamidothion)、ピラクロホス (pyraclophos)、ピリダフェンチオン (pyridafenthion)、ピリミホス—メチル (pirimiphos-methyl)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェンチオン (fenthion)、フェントエート (phenothoate)、フォスチアゼート (fosthiazate)、ブタチオホス (butathiofos)、プロチオホス (prothiofos)、プロパホス (propaphos)、プロフェノホス (profenofos)、ホサロン (phosalone)、ホスチアゼート (fosthiazate)、マラソン (malathion)、メチダチオン (methidathion)、メトルカルブ (metolcarb)、モノクロトホス (monocrotophos)、B P M C (BPMC)、X M C (XMC)、アラニカルブ (alanycarb)、エチオフエンカルブ (ethiofencarb)、カルバリル (carbaryl)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルボフラン (carbofuran)、キシリルカルブ (xylylcarb)、クロエトカルブ (cloethocarb)、チオジカルブ (thiodicarb)、トリアゼメイト (triazamate)、ピリミカーブ (pirimicarb)、フェノキシカーブ (fenoxycarb)、フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フラチオカルブ (furathiocarb)、プロポクスル (propoxur)、ベンダイオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、メソミル (methomyl)、アクリナトリン (acrinathrin)、イミプロトリン (imiprothrin)、エトフェンプロックス (ethofenprox)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、シグマーサイパーメスリン (sigma-cypermethrin)、シハロトリン (cyhalothrin)、シフルトリン (cyfluthrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、シラフルオフエン (silaflluofen)、テフルトリン (tefluthrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、トラロメトリン (tralomethrin)、フェンバレレート (fenvalerate)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フルシスリネート (flucythrinate)、フル

バリネート (fluvalinate)、フルフェンプロックス (flufenoprox)、フルプロ
 キシフェン (fluproxyfen)、フルメスリン (flumethrin)、プラレトリン (pra
 llethrin)、ベーターシフルトリン (beta-cyfluthrin)、ベンフルスリン (ben
 fluthrin)、ペルメトリン (permethrin)、カルタップ (cartap)、チオシクラ
 ム (thiocyclam)、ベンスルタップ (bensultap)、アベルメクチン (avermecti
 n)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、クロフェンテジン (c
 lofentezine)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、シロマジン (cyromaz
 ine)、ジアフェンチウロン (diafenthion)、ジエノクロル (dienochlor)、
 ジクロルボス (dichlorvos)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、スピノシ
 ン (spinosyn)、スルフラミド (sulfluramid)、テフルベンズロン (teflubenz
 uron)、テブフェノジド (tebufenozide)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)
 、ハイドロプレネ (hydroprene)、バニリプロール (vaniliprole)、ピメトロ
 ジン (pymetrozine)、ピリダベン (pyridaben)、ピリプロキシフェン (pyripr
 oxyfen)、ピリミディフェン (pyrimidifen)、フィプロニル (fipronil)、フ
 エナザキン (fenazaquin)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フルア
 ズロン (fluazuron)、フルシクロクスロン (flucycloxuron)、フルフェノクス
 ロン (flufenoxuron)、ブプロフェジン (buprofezin)、ヘキサフルムロン (he
 xaflumuron)、ヘキシチアゾックス (hexythiazox)、ミルベマイシン (milbemy
 cin)、メトキサジアゾン (metoxadiazon)、ルフエヌロン (lufenuron)、レ
 バミゾール (levamisol)、クロルフェナピル (chlorphenapyr)、NC-184
 (NC-184)、エトキサゾール (etoxazole)、IBP (IBP)、アムプロピルホス
 (ampropylfos)、エジフェンホス (edifenphos)、クロルチオホス (chlorthio
 phos)、トルクロホスーメチル (tolclofos-methyl)、ホセチル (fosetyl)、
 イブコナゾール (ipconazole)、イマザリル (imazalil)、イミベンコナゾール
 (imibenconazole)、エタコナゾール (etaconazole)、エポキシコナゾール (e
 poxiconazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、ジニコナゾール (dinic
 onazole)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、テトラコナゾール (tetra
 conazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、トリアジメノール (triadimeno
 l)、トリアジメホン (triadimefon)、トリチコナゾール (triticonazole)、

トリフォリン (triforine)、ビテルタノール (bitertanol)、ビニコナゾール (viniconazole)、フェナリモル (fenarimol)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フルオトリマゾール (fluotrimazole)、フルコナゾール-シス (furconazole-cis)、フルシラゾール (flusilazole)、フルトリアホル (flutriafol)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ミクロブタニル (myclobutanil)、メトコナゾール (metconazole)、カルペンダジン (cabendazin)、デバカルブ (debacarb)、プロチオカーブ (prothiocarb)、ベノミル (benomyl)、マネブ (maneb)、TPN (TPN)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イプロジオン (iprodione)、イミノクタジン (iminooctadine-albesil)、イミノクタジン酢酸塩 (iminooctadine-triacetate)、エチリモル (ethirimol)、エトリジアゾール (etridiazole)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキシカルボキシ (oxycarboxin)、オキシリニック酸 (oxolinic acid)、オフレース (ofurace)、カスガマイシン (kasugamycin)、カルボキシ (carboxin)、キャプタン (captan)、クロジラコン (clozylacon)、クロベンチアゾン (chlobenthiazone)、シプロジニル (cyprodinil)、シプロフラム (cyprofuram)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、ジクロフルアニド (dichlofluanid)、ジクロメジン (diclomezine)、ジネブ (zineb)、ジメチリモル (dimethirimol)、ジメトモルフ (dimethomorph)、ジメフルアゾール (dimefluazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオフェネート-メチル (thiophanate-methyl)、チフルザミド (thifluzamide)、テクロフタラム (tecloftalam)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリクラミド (triclamide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリフルミゾール (triflumizole)、バリダマイシン A (validamycin A)、ヒメキサゾール (hymexazol)、ピラカルボリド (pyracarbolid)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピリフェノックス (pyrifenoxy)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキロン (pyroquilon)、フェリムゾン (ferimzone)、フェンピクロニル (fenpiclonil)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フサライド (fthalide)、フラメトピル (fur

ametryn)、フララキシル (furalaxyl)、フルアジナム (fluazinam)、フルカルバニル (furcarbanil)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルジオキシニル (fludioxonil)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルトラニル (flutolanil)、ブチオベート (butiobate)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロベナゾール (probenazole)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベノダニル (benodanil)、ペンシクロン (pencycuron)、ミクロゾリン (myclozolin)、メタラキシル (metalaxyl)、メトスルホバックス (metsulfosax)、メトフロキサム (methfuroxam)、メパニピリム (mepanipyrim)、メプロニル (mepronil)、クレソキシム-メチル (kresoxim-methyl)、アゾキシストロビン (azoxystrobin)、SSF-126 (SSF-126) 及びカルプロパミド (carpropamid)。

【 0 0 1 7 】

NACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩を畜舎または鶏舎のハエ類の防除に使用するにあたっては、上記したNACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩を含有する組成物を畜舎または鶏舎内のハエ類の棲息場所及び飛来場所に自体公知の方法により散布し、ハエ類昆虫に接触あるいは摂取させることにより駆除することができる。飛翔しているハエ類成虫を駆除するために畜舎または鶏舎内において空間散布してもよいし、主に幼虫が棲息している場所（例えば糞、落ちこぼれ飼料等）に散布してもよい。好ましい剤形は水溶剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粉剤及び乳剤である。施用量は、施用時期、施用場所、施用方法等に応じて広範囲に変えることができるが、一般的には1平方メートル当たり有効成分（NACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩）が約0.1mg～10g、好ましくは約1mg～1gとなるように施用することが望ましい。組成物が通常水で希釈して使用する剤である場合には、有効成分の最終濃度が約0.1～10,000ppm、好ましくは約10～500ppmの範囲となるように希釈して使用すればよい。

また別の形態として、例えば上記した組成物を畜舎または鶏舎内に塗布するか、あるいは毒餌として静置することによりハエ類を駆除することもできる。より具体的には、例えば上記組成物を畜舎または鶏舎の壁、戸、柱、窓、床、天井、

梁等に、場合によっては誘引剤（例えば砂糖、食酢、糖蜜、粉末ミルク、ふすま等）の一種または二種以上（好ましくは一種以上、三種以下）と共に塗布または散布する。薬剤を処理した板類（例えば10cm×20cm～1m×2m）を畜舎または鶏舎内に持ち込み、静置または吊り下げてもよい。薬液濃度は有効成分として0.001%から20%が好ましく、添加する誘引剤の量は1%～20%が好ましい。毒餌としては例えば砂糖、食酢、糖蜜、粉末ミルク、ふすま等の誘引剤（一種または二種以上、好ましくは一種以上、三種以下）と上記したNACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩を含有する組成物（水溶剤、水和剤、顆粒水和剤等が好ましい）とを水で希釈したものを使用する。有効成分及び誘引剤の好ましい濃度は上記畜舎または鶏舎内に塗布する場合と同様である。調製した毒餌は例えば適当な大きさ（例えば10cm×10cm～1m×2m）のトレイに投入し、使用することができる。トレイ中に紙や布を敷くのも成虫が止まるのに効果的である。また、例えば横穴をあけたペットボトルに適当量（50ml～500ml）の毒餌を投入したものを簡易トラップとして使用することもできる。

【0018】

【発明の効果】

NACRに対して結合活性を有する化合物またはその塩はハエ類に対し極めて高活性であることから、畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類を即効的に、また効率的に防除できる。また、従来使用されてきた有機リン剤やピレスロイド剤などの薬剤への抵抗性のハエ類に対しても優れた防除効果を有していることから、ハエ類に起因する家畜・家禽類、人間への各種疾病の伝播が防げるとともに、畜産・養鶏業従事者や周辺住民の不快感が低減される。畜舎または鶏舎が衛生的に保たれるため畜産・養鶏業の発展に大きく貢献し得る。

【0019】

【実施例】

次に、製剤例、実施例および試験例を挙げて、本発明をさらに詳しく説明する。

製剤例1 クロチアニジン50%顆粒水和剤の調製

クロチアニジン	50部
アルケニルスルホン酸塩	10部
ラジオリイト#200を加えて	100部

上記の原料を乳鉢で十分混合した後、水道水25部を添加して練合した。その後練合物を0.8mm径のスクリーンを用い、押出造粒機（菊水製作所、RG-5M）にて円柱状の顆粒に造粒した。得られた顆粒を60℃で1時間乾燥してクロチアニジン50%顆粒水和剤を得た。

【0020】

実施例1 畜舎及び鶏舎塗布用薬液の調製

クロチアニジン50%顆粒水和剤10g及び砂糖10gを混合し水を加えて全量を100mlとした。

【0021】

実施例2 毒餌用薬液の調製

砂糖、酢、粉末ミルク（子豚離乳用飼料）1:5:10の混合物100gとクロチアニジン50%顆粒水和剤10gを混合し、水を加えて全量を500mlとした。

【0022】

試験例1 イエバエに対する経口殺虫試験

クロチアニジンのアルコール溶液を5%ザラメ液で希釈し、クロチアニジン50ppmの薬液を調製した。

3～4時間水分を摂取させていない感受性系統の雌イエバエ成虫（10匹）を麻酔して、短冊状に切った粘着シートに軽く固定した。供試虫が麻酔から醒めた後、微量滴下装置に取り付けた注射針から1μLの薬液（クロチアニジン0.05μgを含む）を放出させ、これを供試虫に吸引させた。24時間後、全てのハエの死亡が確認された。

【書類名】要約書

【要約】

【課題】 畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類の防除方法の提供。

【解決手段】 昆虫のニコチン性アセチルコリン受容体に対して結合活性を有する化合物またはその塩を用いることを特徴とする畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類の防除方法。該化合物またはその塩はハエ類に対し極めて高活性であることから、畜舎または鶏舎に棲息または飛来するハエ類を即効的に、また効率的に防除できる。また、従来使用されてきた有機リン剤やピレスロイド剤などの薬剤への抵抗性のハエ類に対しても優れた防除効果を有していることから、ハエ類に起因する家畜・家禽類、人間への各種疾病の伝播が防げるとともに、畜産・養鶏業従事者や周辺住民の不快感が低減される。畜舎または鶏舎が衛生的に保たれるため畜産・養鶏業の発展に大きく貢献し得る。

【選択図】 なし

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [000002934]

1. 変更年月日 1992年 1月22日

[変更理由] 住所変更

住 所 大阪府大阪市中央区道修町四丁目1番1号
氏 名 武田薬品工業株式会社



Creation date: 11-21-2003
Indexing Officer: THAN - TIFFANY HAN
Team: OIPEBackFileIndexing
Dossier: 09840820

Legal Date: 09-10-2001

No.	Doccode	Number of pages
1	IDS	3
2	NPL	5

Total number of pages: 8

Remarks:

Order of re-scan issued on